

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 02-040324

(43)Date of publication of application : 09.02.1990

(51)Int.Cl.

A61K 31/275  
A61K 31/275  
// A01N 47/40

(21)Application number : 63-186720

(71)Applicant : MEIJI SEIKA KAISHA LTD

(22)Date of filing : 28.07.1988

(72)Inventor : TAKAGI MASAYUKI  
SASAKI TORU  
MIYAJI SHINJI  
OKADA TADAAKI  
SHOMURA TAKASHI  
SEZAKI MASAJI  
AKAI NAOTOSHI  
INOUE SHIGE HARU

## (54) ANTHELMINTIC CONTAINING XANTHOCILLIN X MONOMETHYL ETHER

## (57)Abstract:

PURPOSE: To provide an anthelmintic having a simple and sure anthelmintic effect against the parasites of livestock in an extremely small amount compared with conventional anthelmintics, containing a known antibiotic xanthocillin X monomethyl ether.

CONSTITUTION: The subject contains as an active ingredient xanthocillin X monomethyl ether of the formula: 1-(p-hydroxyphenyl)-2,3-diisocyano-4-(p-methoxyphenyl)-buta-1,3-diene which is an antibiotic obtained from the cultured solution of a fungus such as *Dicholomomyces albus*, *Aspergillus* sp., etc. The compound is employed for treating and preventing the infectious diseases of paracites wherein the administration of the compound is performed by a method of compulsorily administering a liquid preparation thereof with an administration tool such as a stomach probe, a method of mixing with a feed or drinking water, a subcutaneous injection or intramuscular injection method, etc., for the treatment of the paracite infectious and by a method of mixing with a feed, etc., for the prevention of the diseases.

## LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of ]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

平2-40324

⑬ Int. Cl.<sup>5</sup>

A 61 K 31/275

// A 01 N 47/40

識別記号

AEC  
AFJ

庁内整理番号

7330-4C

6779-4H

⑭ 公開 平成2年(1990)2月9日

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全4頁)

⑮ 発明の名称 キサントシリンXモノメチルエーテルを含有する駆虫剤

⑯ 特 願 昭63-186720

⑰ 出 願 昭63(1988)7月28日

⑱ 発 明 者 高 木 誠 之 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社  
薬品研究所内

⑲ 発 明 者 佐 々 木 徹 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社  
薬品研究所内

⑲ 発 明 者 宮 道 慎 二 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社  
薬品研究所内

⑲ 発 明 者 岡 田 忠 昭 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社  
薬品研究所内

⑳ 出 願 人 明治製菓株式会社 東京都中央区京橋2丁目4番16号

㉑ 代 理 人 弁理士 湯 本 宏

最終頁に続く

## 明 細 書

## 1. 発明の名称

キサントシリンXモノメチルエー  
テルを含有する駆虫剤

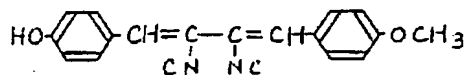
## 2. 特許請求の範囲

(1) キサントシリンXモノメチルエー  
テルを有効成分として含有する駆虫剤

## 3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は下記の化学構造式で示される公知の抗生物質、キサントシリンXモノメチルエーテルの用途に関するものである。さらに詳しくは、キサントシリンXモノメチルエーテルを含有する家畜家禽等の寄生虫の駆虫剤に関するものである。

従来の技術

駆虫作用を有する化合物は多数知られており、本物質の如く微生物の生産物で駆虫活性を有する

物質としては、デストマイシン、ハイグロマイシン、アベルノクチン等が挙げられる。

発明が解決しようとする課題

前記のとおり多数の駆虫剤が知られているが、寄生虫病は、豚、馬、牛、羊、山羊、犬、猫等の家畜動物や鶏などの家禽動物において現在も流行しており、かつ経済的に深刻な問題である。

すなわち寄生虫の感染によって、感染動物は貧血症、栄養不良、虚弱、体重の減少、胃、腸管壁および他の組織、器官の損傷をひきおこし、飼料効率の低下、生産性低下の原因のひとつとなって経済的損失が大きい。従って、新規な駆虫剤を提供することは常に求められている課題である。

課題を解決するための手段

前記の問題点を解決するために本発明はキサントシリンXモノメチルエーテル[1-(p-ヒドロキシフェニル)-2,3-ジイソシアノ-4-(p-ノトキシフェニル)-ブタ-1,3-ジエン]を含有する駆虫剤を提供するものである。キサントシリンXモノメチルエーテルはK.Andoら(J.Antibiotics

21, 582-587, 1968)によって既に報告されている公知の抗生物質で、シコトモミセス・アルブス(Dichotomomyces albus), アスペルギルス属(Aspergillus sp.)等のカビの培養液から得られた物質である。

本物質はグラム陽性菌および陰性菌に対する抗菌活性、ニューキャッスル病ウイルスおよびヘルペスウイルス等に対する抗ウイルス作用、さらにはプロスタグランジンの合成阻害および血小板凝集抑制作用等の活性を有することが知られている。

しかし、われわれは今回新たに本物質が動物の寄生虫に対する駆虫活性を有することを発見した。

キサントシリンXモノメチルエーテルを駆虫剤として適用しようとする動物は豚、馬、兎、牛、羊、山羊、鶏、アヒル、七面鳥、二十日ネズミ、大黒ネズミ、モルモット、サル、犬、猫、小鳥等の家畜、家禽、実験動物、ペット等を挙げることができる。また、これらの動物の寄生虫としては、たとえば犬、猫、牛、山羊、馬、鶏の条虫、馬、豚、犬、猫、鶏の回虫、馬の蟯虫、馬、豚、羊、

山羊の悍虫、豚、羊、犬の鞭虫、馬の円虫、牛、豚、羊、山羊の腸結節虫、牛、羊、犬の十二指腸虫(鈎虫)、牛、豚、羊、山羊の毛線線虫、牛、馬、羊、山羊の胃虫、鶏、七面鳥、アヒルの毛体虫と盲腸虫、牛、馬、羊、山羊、犬の糸状虫、牛、馬、羊、山羊、豚、犬、猫の肝臓に寄生する肝蛭と消化器系に寄生する双口吸虫などの吸虫類、その他、種々の寄生虫が知られている。

キサントシリンXモノメチルエーテルは寄生虫感染症の治療および予防のために用いることができる。治療のための投与方法は経口的又は非経口的な方法がある。経口的に投与する場合は、液状の製剤を胃ゾンデ等の投与器具を用いて強制的に投与する方法、通常の飼料又は飲料水に混合して投与する方法、又は、通常の経口投与に適した剤型、例えば錠剤、カプセル剤、ペレット剤、巨丸剤、粉剤あるいは軟カプセル剤等の剤形で投与する方法がある。非経口的に投与する場合は、ビーナッツ油、大豆油等の非水溶性処方、グリセロール、ポリエチレングリコール等の水溶性処方を注

射などにより皮下、筋肉内、静脈内、腹腔内等に投与する。また、寄生虫の予防のための投与方法は通常用いられている飼料に混合し経口的に投与するのが一般的な方法である。投与期間は予防の場合特に制限がないが、通常肉用鶏では約2か月、豚では5か月で充分であることが多い。

キサントシリンXモノメチルエーテルの投与量は対象動物および寄生虫の種類、あるいは投与方法により異なる。例えば、鶏の回虫を駆除するために液状製剤を胃ゾンデを用いて経口的に投与する場合は5mg/kg以上、好ましくは5mg/kg~20mg/kgを投与する。また、予防のための投与量は飼料中5ppm以上が好ましく5ppm~20ppmの濃度で連続的に投与する。

#### 実施例1

既に鶏回虫(Ascaridia galli)感染症に罹っているのが確認されている鶏にキサントシリンXモノメチルエーテルを1回経口投与してその鶏回虫感染症を治療した実施例を次に示す。

一羽当たり体重80g前後の雛12羽に対し、回虫

の感染卵を各羽約200個経口感染させた。回虫の感染5週後、鶏の糞便1g中の虫卵数(E.P.C.)を検査して確実に虫卵が排泄されていることを確認して、3羽宛4群に分けた。その4群はキサントシリンXモノメチルエーテル5mg/kg投与群、10mg/kg投与群、20mg/kg投与群、残りの1群は全くキサントシリンXモノメチルエーテルを投与しない無投与対照群とした。キサントシリンXモノメチルエーテルは各鶏毎の体重から正確に計算した投与量だけを計量し、ゼラチンカプセルに充填し、これを胃ゾンデで強制的に経口投与した。これらの鶏は一羽毎に金網製の鳥籠に入れ、金網敷きの床から落下する排泄物をステンレス製の受け皿に受け、投与開始の当日から7日間の間毎日排泄された子虫を丹念に数えると同時に体重と一般状態を観察し、その観察の終了日に全ての鶏を解剖して消化管内の内部寄生虫を全て計測して残存虫体数とし、7日間に排泄された子虫数と合わせて排虫率を求めた。その結果は表1, 2に示す通りである。

表1. 個体別排虫効果

群	動物 NO.	投薬 (投薬開始後の個体別排虫数)						
		1日	2日	3日	4日	5日	6日	7日
無投与	1	0	0	0	0	0	0	0
	2	0	0	0	0	0	0	0
	3	0	0	0	0	0	0	0
5mg/kg	4	1	2	2	0	0	0	2
	5	0	0	0	0	0	0	1
	6	0	0	0	0	0	0	2
10mg/kg	7	54	17	0	0	0	1	0
	8	24	18	0	2	0	0	0
	9	33	16	1	1	0	0	0
20mg/kg	10	75	23	0	0	0	0	0
	11	59	4	5	0	0	0	0
	12	58	12	1	0	0	0	0

すなわち、排虫率は投与した薬物の駆虫効果をそのまま表現する指数とみなされているので、まずその排虫率を見ると、無投与対照群は3羽共排虫がなく、残存虫体数のみであったのでその排虫率は0%であったのに対し、5mg/kg投与群では平均8%、10mg/kg投与群では平均69.7%、20mg/kgの投与群では平均100%で完全に駆除されており、投薬群の殆どでは投薬後2日間以内に殆どの子虫が排泄されていた。すなわち、10mg/kg以上の投与量で顕著な効果が得られた。

次に、体重変化を見ると、試験開始時と試験終了時の体重の差から求めた増体率は投与対照群では平均22.4%であったのに対し5mg/kg投与群では平均20.6%、10mg/kg投与群では平均21.7%、20mg/kg投与群では平均24.3%増加したので増体率は無投与対照群の増体率と比べ差はなく、一般状態にも著明な変化がなかった。

従って、この駆虫試験では10mg/kgないし20mg/kgの投与量でキサントシリンXモノノチルエーテルの確実な駆虫効果が確認された。

表2. 個体別平均排虫率および増体率

群	動物 NO. 平均	虫体		排虫数 (%)	体重(g)		増体率 (%)
		排虫数	残虫数		試験前	試験後	
無投与	1	0	133	0	203	244	20.2
	2	0	78	0	233	280	20.2
	3	0	41	0	175	222	26.9
	平均			0			22.4
5mg/kg	4	7	33	17	140	178	25.7
	5	1	58	1	156	185	18.8
	6	2	27	6	168	195	17.5
	平均			8			20.6
10mg/kg	7	72	21	77.4	150	179	19.3
	8	44	24	64.7	151	190	25.8
	9	51	25	67.1	153	182	20.0
	平均			69.7			21.7
20mg/kg	10	98	0	100	178	214	20.2
	11	88	0	100	183	227	24.0
	12	71	0	100	122	157	28.7
	平均			100			24.3

#### 発明の効果

表1, 2に示したごとく、キサントシリンXモノノチルエーテルを含有する駆虫剤は家畜の寄生虫に対し従来の駆虫剤にくらべ極めて少量で簡便かつ確実な駆虫効果を有する。

特許出願人 明治製菓株式会社

代理人 弁理士 湯本 宏



第1頁の続き

⑫発明者	庄村	喬	神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 薬品研究所内	明治製菓株式会社
⑫発明者	瀬崎	正次	神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 薬品研究所内	明治製菓株式会社
⑫発明者	赤井	直利	神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 薬品研究所内	明治製菓株式会社
⑫発明者	井上	重治	神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 薬品研究所内	明治製菓株式会社